

# 特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第 12 条、法施行規則第 56 条）  
〔PCT36 条及び PCT 規則 70〕

REC'D 22 DEC 2005

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 P2-04N08248	今後の手続きについては、様式 PCT/ IPEA/ 416 を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2005/001623	国際出願日 (日.月.年) 27. 01. 2005	優先日 (日.月.年) 30. 01. 2004
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. C07D223/14, C07C249/02, 251/24, C07D471/10, 498/10 // C07B53/00, 61/00, C07M7:00		
出願人 (氏名又は名称) 長瀬産業株式会社		

- この報告書は、PCT35 条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第 57 条 (PCT36 条) の規定に従い送付する。
- この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 6 ページからなる。
- この報告には次の附属物件も添付されている。
  - ☒ 附属書類は全部で 67 ページである。
    - ☒ 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙 (PCT 規則 70.16 及び実施細則第 607 号参照)
    - ☐ 第 I 欄 4. 及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
  - ☐ 電子媒体は全部で (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。  
(実施細則第 802 号参照)

4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- ☒ 第 I 欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第 II 欄 優先権
- ☐ 第 III 欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第 IV 欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第 V 欄 PCT35 条 (2) に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☐ 第 VI 欄 ある種の引用文献
- ☐ 第 VII 欄 国際出願の不備
- ☒ 第 VIII 欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 20. 10. 2005	国際予備審査報告を作成した日 07. 12. 2005		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	特許庁審査官 (権限のある職員) 安藤 倫世	4 P	9837
	電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

様式 PCT/ IPEA/ 409 (表紙) (2005 年 4 月)

## 第 I 欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願  
☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である \_\_\_\_\_ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
- ☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))  
☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))  
☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☐ 出願時の国際出願書類☒ 明細書

第 1-200 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☒ 請求の範囲

第 2-8, 10-16, 18-30 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
第 1, 9, 17 \_\_\_\_\_ 項\*、20.10.2005 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの  
第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付かで国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 1-30	有
	請求の範囲	無
進歩性 (IS)	請求の範囲	有
	請求の範囲 1-30	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 1-30	有
	請求の範囲	無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1: OOI, T. et al., Design of N-Spiro C<sub>2</sub>-Symmetric Chiral Quaternary Ammonium Bromides as Novel Chiral Phase-Transfer Catalysts : Synthesis and Application to Practical Asymmetric Synthesis of  $\alpha$ -Amino Acids, Journal of the American Chemical Society, 2003年, Vol.125, No.17, pp.5139-5151

文献2: OOI, T., "Molecular Design of a C<sub>2</sub>-Symmetric Chiral Phase-Transfer Catalyst for Practical Asymmetric Synthesis of  $\alpha$ -Amino Acids." J. Am. Chem. Soc., 1999年, Vol.121, No.27, pp.6519-6520

文献3: JP 2001-48866 A (長瀬産業株式会社) 2001.02.20 & WO 01/81349 A1 & EP 1277755 A1 & US 6340753 B1

文献4: ABBOT, A. P., "Electrochemical recognition of charged species using quaternary ammonium binaphthyl salts" Analyst (Cambridge, United Kingdom), 2001年, Vol.126, No.11, pp.1892-1896

文献5: STARA, I. G., "Nucleophilic cleavage of 4,5-dihydro-3H-dinaphth[2,1-c:1',2'-e]azepinium quaternary salts. A convenient approach to new axially dissymmetric and axially asymmetric ligands" Journal of Organic Chemistry, 1992年, Vol.57, No.25, pp.6966-6969

文献6: STARA, I. G., "Stereochemical Dichotomy in the Stevens Rearrangement of Axially Twisted Dihydroazepinium and Dihydrothiepinium Salts. A Novel Enantioselective Synthesis of Pentahelicene" Journal of the American Chemical Society, 1994年, Vol.116, No.12, pp.5084-5088

文献7: STARA, I. G., "Nucleophilic Attack on 4,5-Dihydro-4-alkyl-3H-dinaphtho[2,1-c:1',2'-e]thiepinium Salts. A Convenient Approach to New 2,2'-Bidentate 1,1'-Binaphthalene Ligands with Sulfur Donor Atoms" Journal of Organic Chemistry, 1994年, Vol.59, No.6, pp.1326-1332

## 第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1－30に係る発明は、式（I）で表される化合物又はそれを触媒とする反応方法等の発明であるが、式（I）における基本骨格を有する化合物が、文献（JP 2001-48866 A（長瀬産業株式会社）2001.02.20）等により公知であるから、本願発明化合物は、その化学構造において、新規な基本骨格が共通しているものとはいえない。してみれば、このような化合物を記載する上記請求の範囲各項からは、一の発明を明確に把握することができない。

また、特許協力条約第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、特許協力条約第5条の意味において明細書に開示されているものは、請求の範囲 1－30の発明における式（I）で表される化合物の中の、ごく僅かな部分に過ぎない。

したがって、請求の範囲 1－30及び明細書は、有意義な国際調査をすることができる程度まで所定の要件を満たしていない。

なお、本願明細書の記載内容に照らし、先行技術文献調査を試みた結果、その調査の一部において、本願発明化合物に該当する化合物が多数発見されたが、当該化合物については、2005. 10. 20付け補正にて請求の範囲から除外された。

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

文献 8 : STARA, I. G., "Optically pure (S)- and (R)-4,5-dihydro-3H-4-methyldinaphth[2,1-c;1',2'-e]azepines. Application to the synthesis of new bidentate ligands with axial asymmetry" Tetrahedron: Asymmetry, 1992 年, Vol.3, No.11, pp.1365-1368

文献 9 : COTTINEAU, F., "Reductive cleavage of axially dissymmetric tertiary amines and quaternary ammonium salts by lithium aluminum hydride. Synthesis of new 1,1'-binaphthyl substituted amines" Tetrahedron Letters, 1985 年, Vol.26, No.4, pp.421-424

文献 10 : DI BARI, L., "Conformational Study of 2,2'-Homosubstituted 1,1'-Binaphthyls by Means of UV and CD Spectroscopy" Journal of the American Chemical Society, 1999 年, Vol.121, No.35, pp.7998-8004

文献 11 : SHI, M., "Synthesis of axially dissymmetric chiral ammonium salts by quaternization of secondary amines with (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-6,6'-dinitrobiphenyl and (R)-(+)-2,2'-bis(bromomethyl)-1,1'-binaphthyl and an examination of their abilities as chiral phase-transfer catalysts" Journal of Chemical Research, Synopses, 1995 年, No.2, pp.46-47

文献 12 : MASON, S. F., "Optical activity in the biaryl series" Tetrahedron, 1974 年, Vol.30, No.12, pp.1671-1682

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

請求の範囲 1-30 に記載された発明は、国際調査報告で引用された上記文献 1-12 により進歩性を有しない。

文献 1-12 には、本出願の式 (I) で表される化合物に類似する種々の軸不斉化合物が記載されている (文献 1 第 5144 頁、文献 2 第 6520 頁、文献 3 第 27-28 頁、文献 4 第 1893 頁、文献 5 第 6966 頁、文献 6 第 5085 頁、文献 7 第 1327 頁、文献 8 第 1366 頁、文献 9 第 421-422 頁、文献 10 第 8022 頁、文献 11 第 46-47 頁、文献 12 第 1675 頁参照)。

補正後の請求項に係る化合物は、これら文献 1-12 に、具体的に記載された化合物を除くものであるが、当業者であれば、例えば、文献 11 に記載された化合物 4a (4 級アンモニウム基を 5 員環であるピロールから合成したもの)、化合物 4b (4 級アンモニウム基を 6 員環であるピペリジンから合成したもの) から、4 級アンモニウム基を含窒素 3~8 員環から合成した化合物を想到すること、それを同様の用途に用いることは、容易に行い得ることである。

また、文献 6 に記載された化合物 6 (4 級アンモニウム基にジメチルを持つもの)、化合物 7 (4 級アンモニウム基にメチルと n-ブチルを持つもの)、化合物 8 (4 級アンモニウム基にメチルとイソプロピルを持つもの) から、例えば、4 級アンモニウム基にメチルとエチルを有する化合物を想到すること、それを同様の用途に用いることも、当業者が容易に行い得ることである。

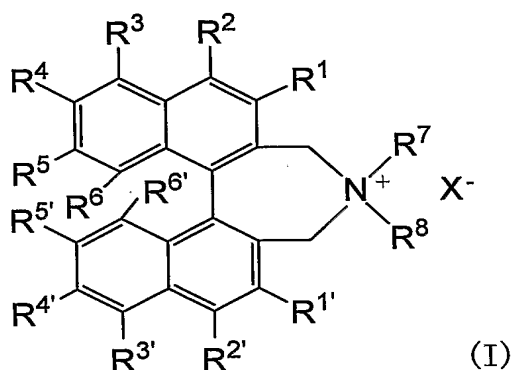
そして、本出願の式 (I) で表される基本骨格を有する化合物であれば不斉合成触媒として有用であることが公知であるから (例えば文献 6、文献 11 参照)、文献 1-3 に記載のアミノ酸合成方法においても、文献 1-12 に記載の軸不斉化合物に類似する化合物を触媒として用いてみることも、当業者が容易に行い得ることであり、アミノ酸合成における不斉合成触媒としての効果を確認したことをもって、格別のものとすることはできない。

また、文献 1-3 に記載の軸不斉化合物の触媒量に基づいて、これを実験的に好適化してみることが、当業者の通常の創作能力の発揮に過ぎず、この点に格別の創意を見出せない。

更に、エステル基が酸でも塩基でも加水分解し得ることは技術常識であるから、文献 1-3 の記載に基づいて、イミノ基及びエステル基の加水分解方法を好適化してみることが、当業者にとって容易である。

## 請求の範囲

1. (補正後) 以下の式 (I) で表される、化合物：



ここで、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii)  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；

(vii)  $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；

(viii)  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

5 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

25 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、



分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$   
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま  
たは $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素  
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアラルキル基；

(xiv)アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$   
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま  
たは $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

10 基である)、

ハロゲン原子、および

$-S(O)_n-R$  (ここで、 $n$ は0、1または2であり、そして $R$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいが、

15 あるいは3、4位が一緒になって $-O-(CH_2)_m-O-$  (ここで、 $m$ は1または2である) で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

25 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

15 (ii)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルキニル基；

(v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

20 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基；

(vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

25

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、  
N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、  
-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)、および

5 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基；

(vii) - ( $CH_2$ )<sub>n</sub>OCO $NR^{10}R^{11}$  (ここで、 $R^{10}$ および $R^{11}$ はそれ  
ぞれ独立して、

- 10 (1)水素原子、  
(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
(3)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；  
(4)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；  
(5)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

15 が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、- $NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
20  $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アル  
キル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、  
または-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25 - $NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

5        -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
ラルキル基；

10        (6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘ  
テロアリール部分が、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>2</sup>

15        <sup>1</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~  
C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20        シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、  
水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25        N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であつて、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5  $^1$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15  $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

(viii)  $-(CH_2)_n CONR^{12}R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ

25 独立して、

(1)水素原子、



(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

5 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim$   
 $C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アル  
キル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキ  
10 ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、  
水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

15 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アル  
キル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

25 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

(ix)  $-(CH_2)_nNR^{12}COR^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
5 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
15 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
25 キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
る) ;

(x)  $-(CH_2)_nNR^{12}R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞれ独立  
して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
25  $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$   
キル) カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

または $\text{-NHCO}R^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}R^{21}$ （ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $C_1\sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N\text{-(}C_1\sim C_4\text{アルキル)カルバモイル基、}$

$N,N\text{-ジ}(C_1\sim C_4\text{アルキル)カルバモイル基、}$

10  $\text{-NHCO}R^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1\sim C_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}R^{21}$ （ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1\sim C_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $N\text{-(}C_1\sim C_4\text{アルキル)カルバモイル基、}$   
 $N,N\text{-ジ}(C_1\sim C_4\text{アルキル)カルバモイル基、}$   
または $\text{-NHCO}R^9$ （ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1\sim C_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25  $\text{-NR}^{20}R^{21}$ （ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1\sim C_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

5        -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

10        からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ;

(xi) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Y-OR<sup>12</sup> (ここで、Yは分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>の二価の飽和炭化水素基であり、R<sup>12</sup>は、

(1)水素原子、

15        (2)分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>2</sup>

20        <sup>1</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25        シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>2</sup>

15 <sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(xii) —(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>—OR<sup>12</sup>（ここで、R<sup>12</sup>は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

<sup>1</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N,N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N,N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、



—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アル  
 キル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 5 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
 （ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～  
 C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アル  
 キル）カルバモイル基、N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、  
 または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキ  
 ル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

15 シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、  
 水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

20 N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アル  
 キル基である）、および

ハロゲン原子

25 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xiii) — (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> — S — R<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>5</sub> アルコキシ基、

分岐していてもよい C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、

水素原子またはC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

N, N—ジ(C<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub> ~ C<sub>4</sub> アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

- (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
5  $^1$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、  
10 シアノ基、  
 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
15  $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
ハロゲン原子  
20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、  
からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;  
(xiv)  $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、  
25 (1)水素原子、  
(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

5  $^1$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

10 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

15  $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

20 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

25 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

$^1$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim$

C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である) ; ならびに

(xv) -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-SO<sub>2</sub>-R<sup>12</sup>(ここで、R<sup>12</sup>は、

20 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

25 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
<sup>1</sup>(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~

C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

5 シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

10 N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

ハロゲン原子

15 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

20 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
 (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N-(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N, N-ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または-NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

5  $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

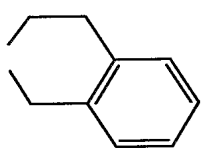
ハロゲン原子

10 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

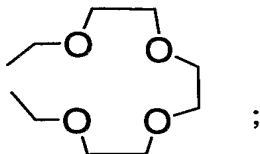
からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

15  $R^7$ および $R^8$ は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$ は2から8の整数である) ;



; および



;

20 からなる群より選択される二価の基を表し、そして

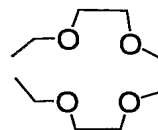
$X^-$ は、ハロゲン化物アニオン、 $SCN^-$ 、 $HSO_4^-$ 、および $HF_2^-$ からなる群より選択されるアニオンであり、

ただし、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ および $R^{6'}$ がすべて水素原子であり、かつ $X^-$ がハロゲン化物アニオンで

25 ある場合、 $R^7$ および $R^8$ が、両方ともメチル基、メチル基と $n$ -ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基

と水素原子との組み合わせではなく、あるいは $R^7$ および $R^8$ が一緒になって

— $(CH_2)_4$ —、— $(CH_2)_5$ —、または



ではない。

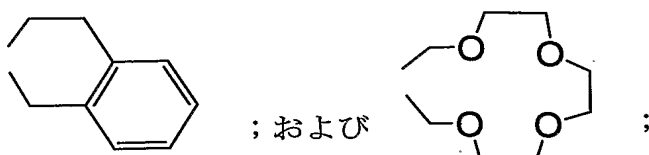
- 5 2. 前記式 (I) で表される化合物の $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ および $R^{6'}$ が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；



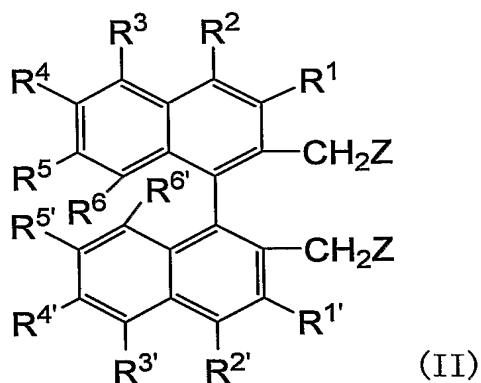
7. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  が同一である、請求項 6 に記載の化合物。

8. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は 2 から 8 の整数である) ；

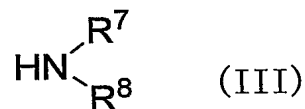


10 からなる群より選択される二価の基を表す、請求項 1 に記載の化合物。

9. (補正後) 請求項 1 に記載の、式 (I) で表される化合物を製造するための方法であって、  
以下の式 (II) :



で表される化合物を、有機溶媒中、酸捕捉剤の存在下にて、  
以下の式 (III) :



で表される 2 級アミンと反応させる工程、を包含し、

ここで、式 (I I) において、

$R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

5 (ii)  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

(iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

10 (vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；

(vii)  $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基；

(viii)  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；

15 (x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

20 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

5 カルバモイル基、

N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

10 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アラルキル基；

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

15 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）

20 カルバモイル基、N，N—ジ（C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル）カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素

25 原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアラルキル基;

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>  
4 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ

15 ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、ま  
たは-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素  
20 原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

25 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
基である)、

ハロゲン原子、および

—S(O)<sub>n</sub>—R (ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、  
5 あるいは3、4位が一緒になって—O—(CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub>—O—(ここでmは1または2である)で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

(xv)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、N、N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル  
15 基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N、N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>(ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、へ

テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、そして

Zはハロゲン原子であり、

そして式 (I I I) において、

5 R<sup>7</sup>およびR<sup>8</sup>はそれぞれ独立して、

(i)水素原子；

(ii)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>のアルキル基；

(iii)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルケニル基；

(iv)分岐または環を形成していてもよい、C<sub>2</sub>～C<sub>12</sub>のアルキニル基；

10 (v)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

(ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)

カルバモイル基、N, N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 —NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

25 N, N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基;

- 5 (vi)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、  
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C$   
10  $_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま  
たは $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)で置換されていてもよい、アリール基、  
シアノ基、  
15  $-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素  
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、  
ニトロ基、  
カルバモイル基、  
 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
20  $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)、および  
ハロゲン原子  
からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
25 テロアリール基;  
(vii) $-(CH_2)_nOCONR^{10}R^{11}$ (ここで、 $R^{10}$ および $R^{11}$ はそれ

ぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

5 (4) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

(5) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分

が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

10 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

15

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

20

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

25

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ア



ラルキル基；

(6)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

5 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
10 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および  
20

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(7)アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
5 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
15 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基、ならびに

(8)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
25 キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
 る) ;

(viii)  $-(CH_2)_nCONR^{12}R^{13}$  (ここで、 $R^{12}$ および $R^{13}$ はそれぞ  
 れ独立して、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

20 (3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
 1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 25  $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$   
 キル) カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

または $\text{-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、

5 水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$

10  $\text{-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

15 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_5$ アルコキシ基、

20 分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$   
 $\text{N, N-ジ (C}_1\sim\text{C}_4\text{アルキル) カルバモイル基、}$   
または $\text{-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25  $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ アルキル基である）、

- ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 5        -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
 キル基である)、および  
       ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアリール基、  
 10        からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ  
       る) ;  
       (ix) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>12</sup>CO R<sup>13</sup> (ここで、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>はそれぞれ  
       独立して、  
       (1) 水素原子、  
       (2) 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 15        (3) アリール基であって、該アリール基が  
       分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
       分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
       分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>2</sup>  
 20        <sup>1</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~  
       C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
       キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
       または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
       ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 25        シアノ基、  
       -NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>. (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、

水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

5 N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>2</sup>

15 <sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、または-NHCO $R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

20 シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

25 N- ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

5 テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数である）；

(x) — (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NR<sup>12</sup>R<sup>13</sup>（ここで、R<sup>12</sup>およびR<sup>13</sup>はそれぞれ独立して、

10 (1)水素原子、

(2)分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>5</sub>アルコキシ基、

15 分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

<sup>1</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アル

キル)カルバモイル基、N、N—ジ(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

または—NHCOR<sup>9</sup>（ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキ

20 ル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>（ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル基である）、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

N—(C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル)カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

10 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N— ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

—NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N— ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

—NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

25 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ



テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

(xi)  $-(CH_2)_n Y-OR^{12}$  (ここで、 $Y$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  の二価の飽和炭化水素基であり、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であつて、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アル

キル) カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N$ 、 $N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アル

キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

5 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
 10 または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

20 ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は 1 から 12 の整数である) ;

25

(xii)  $-(CH_2)_n-OR^{12}$  (ここで、 $R^{12}$  は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

5 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、  
10 または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

15 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アル

20 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基、ならびに

(4) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

25 分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 5 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

15  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

20 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数である) ;

(xiii)  $-(CH_2)_n-S-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、

(1)水素原子、

(2)分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3)アリール基であって、該アリール基が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
 キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 5 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ  
 ル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
 水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
 15 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
<sup>1</sup> (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
 25 キル)カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、  
 または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
キル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

15 からなる群より選択される基であり、そして $n$ は1から12の整数であ  
る) ;

(xiv)  $-(CH_2)_n-SO-R^{12}$  (ここで、 $R^{12}$ は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

20 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アル}$   
25 キル) カルバモイル基、 $N, N\text{-ジ}(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、  
または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ

ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

5 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、

10  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アル  
キル基である) 、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基、ならびに

(4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
1 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim$   
 $C_4$ アルキル基である) 、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アル  
20 キル) カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$ アルキル) カルバモイル基、  
または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキ  
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

25  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、  
水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である) 、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル

5 キル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
テロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そしてnは1から12の整数であ  
10 る) ; ならびに

(xv) - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - SO<sub>2</sub> - R<sup>12</sup> (ここで、R<sup>12</sup>は、

(1) 水素原子、

(2) 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

(3) アリール基であって、該アリール基が

15 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
1 (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~  
C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
20 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、

25 水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、



- カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
 5 キル基である)、および  
 ハロゲン原子  
 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 リール基、ならびに  
 (4)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が  
 10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、  
 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
 1 (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~  
 C<sub>4</sub>アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
 15 キル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 または-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
 ル基である) で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 -NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、  
 20 水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、  
 ニトロ基、  
 カルバモイル基、  
 N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 25 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アル  
 キル基である)、および

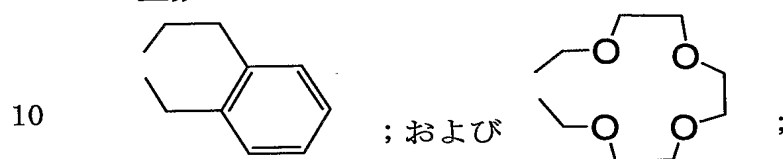
## ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基、

からなる群より選択される基であり、そして  $n$  は1から12の整数である) ;

からなる群より選択される基であるか、あるいは、

$R^7$  および  $R^8$  は一緒になって、 $-(CH_2)_m-$  (ここで、 $m$  は2から8の整数である) ;



からなる群より選択される二価の基を表し、

ただし、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  がすべて水素原子であり、かつ  $X^-$  がハロゲン化物アニオンである場合、 $R^7$  および  $R^8$  が、両方ともメチル基、メチル基と  $n$ -ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基と水素原子との組み合わせではなく、あるいは  $R^7$  および  $R^8$  が一緒になって

15  $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CH_2)_5-$ 、または ではない、  
20 方法。

10. 前記式 (I I) で表される化合物の  $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$  および  $R^{6'}$  が、それぞれ独立して、

(i) 水素原子 ;

25 (xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

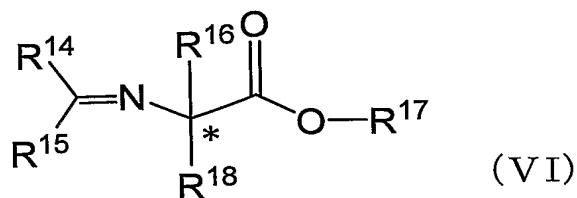
分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

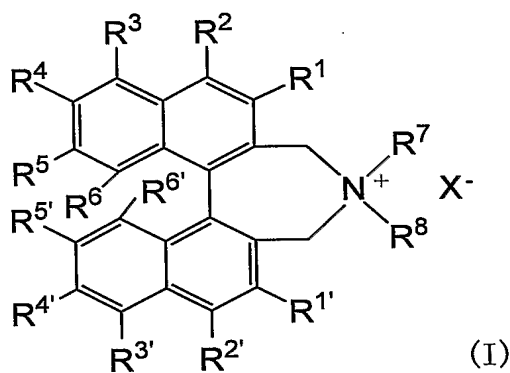
5

17. (補正後) 式 (VI) で表される化合物:

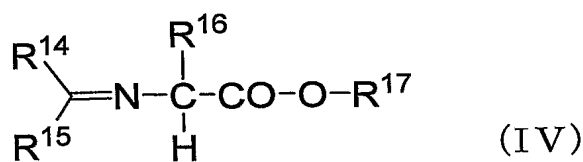


を立体選択的に製造するための方法であって、

軸不斉に関して純粋な式 (I) :



で表される化合物を相間移動触媒として用い、式 (IV) で表される化合物:



を、媒体中、無機塩基の存在下、式 (V) の化合物:



でアルキル化する工程、を包含し、

ここで、式 (I) において、

$\text{R}^1$ 、 $\text{R}^{1'}$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^{2'}$ 、 $\text{R}^3$ 、 $\text{R}^{3'}$ 、 $\text{R}^4$ 、 $\text{R}^{4'}$ 、 $\text{R}^5$ 、 $\text{R}^{5'}$ 、 $\text{R}^6$  および

$R^{6'}$  は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；

(ii)  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

5 (iii) シアノ基；

(iv) ニトロ基；

(v) カルバモイル基；

(vi)  $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基；

(vii)  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基；

10 (viii)  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) ；

(ix) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_6$  のアルキル基；

(x) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルケニル基；

(xi) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$  のアルキニル基；

15 (xii) アラルキル基であって、ここで、該アラルキル基を構成するアリール部分が、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

20 (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

25 シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素

原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

5  $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

$-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア

10 ラルキル基;

(xiii)ヘテロアリール部分を有するヘテロラルキル基であって、ここで、該ヘテロアリール部分が、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、 $N, N$ -ジ $(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、または $-NHCO R^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル

20 基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

25 カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{アルキル})$ カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、  
 -NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
 基である)、および

ハロゲン原子

5 からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ  
 テロアラルキル基；

(xiv) アリール基であって、ここで、該アリール基が、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

10 分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>  
 (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>  
 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
 ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、ま  
 たは-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
 15 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素  
 原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

20 カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
 基である)、

25 ハロゲン原子、および

-S (O)<sub>n</sub>-R (ここで、nは0、1または2であり、そしてRは分

岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよいか、  
あるいは3, 4位が一緒になって  $-O-(CH_2)_m-O-$  (ここで、 $m$ は1  
または2である) で置換されていてもよい、アリール基；ならびに

5 (xv) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$  アルキル)

カルバモイル基、 $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル  
基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素  
原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

20  $N, N$ -ジ ( $C_1 \sim C_4$  アルキル) カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル  
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘ

25 テロアリール基；

からなる群より選択される基であり、

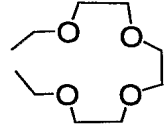


$R^7$ および $R^8$ はそれぞれ独立して、一価の有機基であるか、あるいは一緒になって二価の有機基を表し、

$X^-$ は、ハロゲン化物アニオンであり、

ただし、 $R^1$ 、 $R^{1'}$ 、 $R^2$ 、 $R^{2'}$ 、 $R^3$ 、 $R^{3'}$ 、 $R^4$ 、 $R^{4'}$ 、 $R^5$ 、 $R^{5'}$ 、 $R^6$ および $R^{6'}$ がすべて水素原子であり、かつ $X^-$ がハロゲン化物アニオンで

5  $R^7$ および $R^8$ が、両方ともメチル基、メチル基とn-ブチル基との組み合わせ、メチル基とイソプロピル基との組み合わせ、またはアリル基と水素原子との組み合わせではなく、あるいは $R^7$ および $R^8$ が一緒になって

10  $-(CH_2)_4-$ 、 $-(CH_2)_5-$ 、または  ではなく、

式 (IV) および式 (VI) において、

$R^{14}$ および $R^{15}$ は、それぞれ独立して、

(i) 水素原子；あるいは

15 (ii) 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基か、分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基か、またはハロゲン原子かで置換されていてもよい、アリール基；

であり、ただし $R^{14}$ および $R^{15}$ がともに水素原子である場合を除き、

$R^{16}$ は、

20 (i) 水素原子；

(ii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基；

(iii) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基；

(iv) 分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基；

(v) アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が

25 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$   
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)  
カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま  
5 たは $-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$ (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素  
原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

10 ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$ (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
15 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
ラルキル基；

(vi) ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテ  
20 ロアリール部分が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
(ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$   
25 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)  
カルバモイル基、 $N, N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま

たは $\text{-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、}$

$\text{-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基；

(vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基、シアノ基、 $\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、ニトロ基、カルバモイル基、 $\text{N- (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、N, N-ジ (C}_1 \sim \text{C}_4 \text{アルキル) カルバモイル基、または-NHCOR}^9$ （ここで、 $\text{R}^9$ は分岐していてもよい $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$\text{-NR}^{20}\text{R}^{21}$ （ここで、 $\text{R}^{20}$ および $\text{R}^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ アルキル基である）、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

5        -NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
リール基; ならびに

10        (viii)ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

15        (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>  
アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキ  
ル) カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、ま  
たは-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20        -NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素  
原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

25        N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCOR<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基;

- 5 からなる群より選択される基であり、  
 $R^{17}$ は、分岐または環を形成していてもよい $C_1 \sim C_8$ アルキル基であり、  
 式(V)および式(VI)において、  
 $R^{18}$ は、  
 (i)分岐または環を形成していてもよい、 $C_1 \sim C_{10}$ アルキル基;  
 10 (ii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_3 \sim C_9$ のアリル基または置換アリル基;  
 (iii)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルケニル基;  
 (iv)分岐または環を形成していてもよい、 $C_2 \sim C_6$ のアルキニル基;  
 (v)アラルキル基であって、該アラルキル基を構成するアリール部分が  
 15 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、  
 分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$   
 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$   
 $C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキ  
 20 ル)カルバモイル基、 $N$ 、 $N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、ま  
 たは $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル  
 基である)で置換されていてもよい、アリール基、  
 シアノ基、  
 $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素  
 25 原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、  
 ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル

5 基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ア  
 ラルキル基;

(vi)ヘテロアリール部分を有するヘテロアラルキル基であって、該ヘテロ

10 アリール部分が

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>5</sub>アルコキシ基、

分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基、シアノ基、-NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup>

15 (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>  
 アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル)

カルバモイル基、N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、ま  
 たは-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル  
 基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

20 -NR<sup>20</sup>R<sup>21</sup> (ここで、R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、それぞれ独立して、水素  
 原子またはC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

N- (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

25 N, N-ジ (C<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル) カルバモイル基、

-NHCO R<sup>9</sup> (ここで、R<sup>9</sup>は分岐していてもよいC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキル

基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、ヘテロアラルキル基;

5 (vii) アリール基であって、該アリール基が

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_5$ アルコキシ基、

分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

10 (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、 $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、または $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

15  $-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$ および $R^{21}$ は、それぞれ独立して、水素原子または $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

20  $N,N$ -ジ( $C_1 \sim C_4$ アルキル)カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$ は分岐していてもよい $C_1 \sim C_4$ アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも1つの基で置換されていてもよい、アリール基;

25

(viii) ヘテロアリール基であって、該ヘテロアリール基が

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_5$  アルコキシ基、

分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基、シアノ基、 $-NR^{20}R^{21}$

(ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、ニトロ基、カルバモイル基、 $N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、 $N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、または  $-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である) で置換されていてもよい、アリール基、

シアノ基、

$-NR^{20}R^{21}$  (ここで、 $R^{20}$  および  $R^{21}$  は、それぞれ独立して、水素原子または  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、

ニトロ基、

カルバモイル基、

$N-(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$N, N$ -ジ  $(C_1 \sim C_4 \text{ アルキル})$  カルバモイル基、

$-NHCOR^9$  (ここで、 $R^9$  は分岐していてもよい  $C_1 \sim C_4$  アルキル基である)、および

ハロゲン原子

からなる群より選択される少なくとも 1 つの基で置換されていてもよい、ヘテロアリール基；ならびに

(ix) 分岐していてもよい、 $C_3 \sim C_9$  のプロパルギル基または置換プロパルギル基；

からなる群より選択される基であり、

式 (V) において、

W は、脱離能を有する官能基であり、

そして式 (VI) において



\*は、新たに生成する不斉中心を示す、方法。

18. 前記式 (I) で表される化合物の  $R^7$  および  $R^8$  が、  
それぞれ独立して、

- 5 (i) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_1 \sim C_{12}$  のアルキル基；
- (ii) 分岐または環を形成していてもよく、および／またはハロゲン原子で置換されていてもよい、 $C_2 \sim C_{12}$  のアルケニル基；